

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 5 月 6 日 (06.05.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/039571 A1

(51) 国際特許分類: A61K 31/421, 31/517, 9/06, 9/08,
A61P 27/02 // C07D 263/32, 417/12

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/016460

(22) 国際出願日: 2004 年 10 月 29 日 (29.10.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2003-368548
2003 年 10 月 29 日 (29.10.2003) JP
特願 2003-379801
2003 年 11 月 10 日 (10.11.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 参天
製薬株式会社 (SANTEN PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新
庄 3 丁目 9 番 19 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中村 雅胤 (NAKA-
MURA, Masatsugu) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市
高山町 8916-16 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 平井 慎
一郎 (HIRAI, Shin-ichiro) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生
駒市高山町 8916-16 参天製薬株式会社内 Nara (JP).

(74) 代理人: 日比 紀彦, 外 (HIBI, Norihiko et al.); 〒
5420086 大阪府大阪市中央区西心斎橋 1 丁目 1 3 番
1 8 号 イナバビル 3 階 キシモト特許事務所内 Osaka
(JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告書
- 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受
領の際には再公開される。

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: THERAPEUTIC AGENT FOR KERATOCONJUNCTIVA DISORDER

(54) 発明の名称: 角結膜障害治療剤

(57) Abstract: New medicinal uses of 5-[4-[[3-methyl-4-oxo-3,4-dihydro-2-quinazolinyl]methoxy]phenylmethyl]thiazolidine-
2,4-dione and N-[(4-methoxyphenoxy)carbonyl]-N-[[4-[2-(5-methyl-2-phenyl-4-oxazolyl)ethoxy]phenyl]methyl]glycine. The
compounds each has an excellent ameliorative effect on corneal disorder models and is useful in treatments for keratoconjunctiva
disorders such as dry eye, corneal ulcer, corneitis, conjunctivitis, superficial punctate keratopathy, subepithelial corneal defects,
subepithelial conjunctival defects, keratoconjunctivitis sicca, superior limbic keratoconjunctivitis, and filamentous keratitis.

(57) 要約: 本発明は、5-[4-[[3-メチル-4-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2-キナゾリニル]メトキシ]フェ
ニルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンおよびN-[(4-メトキシフェノキシ)カルボニル]-N-[[4-[2-
(5-メチル-2-フェニル-4-オキサゾリル)エトキシ]フェニル]メチル]グリシンの新たな医薬用途を探索する
ことを課題とする。上記化合物はいずれも、角膜障害モデルにおいて優れた改善効果を発揮し、ドライアイ、角膜
潰瘍、角膜炎、結膜炎、点状表層角膜症、角膜上皮欠損、結膜上皮欠損、乾性角結膜炎、上輪部角結膜炎、糸状角
膜炎などの角結膜障害の治療剤として有用である。



WO 2005/039571 A1